

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
28. April 2005 (28.04.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/037829 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07D 413/12**,
263/58, A61K 31/423, A61P 35/00

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/009743

(22) Internationales Anmeldedatum:
1. September 2004 (01.09.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
103 44 223.5 24. September 2003 (24.09.2003) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von
US): **MERCK PATENT GMBH** [DE/DE]; Frankfurter
Str. 250, 64293 Darmstadt (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **STÄHLE, Wol-**
gang [DE/DE]; Neuweg 14c, 55218 Ingelheim (DE).
JONCZYK, Alfred [DE/DE]; Schepp Allee 57, 64295
Darmstadt (DE). **RAUTENBERG, Wilfried** [DE/DE];
Magdeburger Strasse 13, 64354 Reinheim (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: **MERCK PATENT GMBH**;
Frankfurter Str. 250, 64293 Darmstadt (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM,
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,
ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,
ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,
TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT,
RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA,
GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

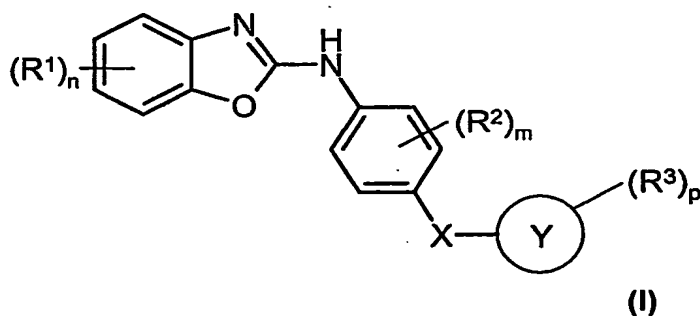
Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Co-
des and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der
PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: 1,3-BENZOXAZOLYL DERIVATIVES AS KINASE-INHIBITORS

(54) Bezeichnung: 1,3-BENZOXAZOLYLDERIVATE ALS KINASE-INHIBITOREN



(57) Abstract: The invention relates to compounds
of formula 1, the production and use thereof as a
medicament for the treatment of diseases, particularly
tumours and/or diseases caused, mediated or
propagated by angiogenesis. The compounds of
formula 1 are effective inhibitors of tyrosin kinases,
particularly TIE-2 and VEGFR, and Raf-kinases. (I)

(57) Zusammenfassung: Verbindungen der Formel
1, deren Herstellung und Verwendung zur Herstellung
eines Medikaments zur Behandlung von Krankheiten,
insbesondere Tumoren und/oder Krankheiten, die
durch Angiogenese verursacht, vermittelt und/oder

propagiert werden. Verbindungen der Formel 1 sind wirksame Inhibitoren der Tyrosinkinasen, insbesondere TIE-2 und VEGFR, und der Raf-Kinasen. (I)

WO 2005/037829 A1